

(19)



Europäisches Patentamt

European Patent Office

Office européen des brevets



(11)

EP 0 965 330 A1

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(43) Veröffentlichungstag:
22.12.1999 Patentblatt 1999/51

(51) Int. Cl.⁶: **A61K 7/48**, A61K 9/107,
A61K 47/24, A61K 47/36

(21) Anmeldenummer: 99110757.4

(22) Anmeldetag: 04.06.1999

(84) Benannte Vertragsstaaten:
AT BE CH CY DE DK ES FI FR GB GR IE IT LI LU
MC NL PT SE
Benannte Erstreckungsstaaten:
AL LT LV MK RO SI

(30) Priorität: 13.06.1998 DE 19826503

(71) Anmelder:
Beiersdorf Aktiengesellschaft
20245 Hamburg (DE)

(72) Erfinder:
• **Kröpke, Rainer**
22869 Schenefeld (DE)
• **Schneider, Günther, Dr.**
22607 Hamburg (DE)

(54) **Kosmetische und dermatologische Zubereitungen mit einem Gehalt an Chitosan und Phospholipiden**

(57) Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen, welche

- (a) Chitosan eines mittleren Molekulargewichtes von 10.000 bis 2.000.000 g/mol und einem Deacetylierungsgrad von 10 bis 99% und
- (b) ein oder mehrere Phospholipide enthalten.

EP 0 965 330 A1

Beschreibung

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische und dermatologische Zubereitungen mit einem Gehalt an Chitosan und Phospholipiden.

[0002] Die Haut ist das größte Organ des Menschen. Unter ihren vielen Funktionen (beispielsweise zur Wärmeregulation und als Sinnesorgan) ist die Barrierefunktion, die das Austrocknen der Haut (und damit letztlich des gesamten Organismus) verhindert, die wohl wichtigste. Gleichzeitig wirkt die Haut als Schutzeinrichtung gegen das Eindringen und die Aufnahme von außen kommender Stoffe. Bewirkt wird diese Barrierefunktion durch die Epidermis, welche als äußerste Schicht die eigentliche Schutzhülle gegenüber der Umwelt bildet. Mit etwa einem Zehntel der Gesamtdicke ist sie gleichzeitig die dünnste Schicht der Haut.

[0003] Die Epidermis ist ein stratifiziertes Gewebe, in dem die äußere Schicht, die Hornschicht (*Stratum corneum*), den für die Barrierefunktion bedeutenden Teil darstellt. Das heute in der Fachwelt anerkannte Hautmodell von Elias (*P. M. Elias, Structure and Function of the Stratum Corneum Permeability Barrier, Drug Dev. Res. 13, 1988, 97-105*) beschreibt die Hornschicht als Zwei-Komponenten-System, ähnlich einer Ziegelsteinmauer (Ziegelstein-Mörtel-Modell). In diesem Modell entsprechen die Hornzellen (Korneozyten) den Ziegelsteinen, die komplex zusammengesetzte Lipidmembran in den Interzellularräumen entspricht dem Mörtel. Dieses System stellt im wesentlichen eine physikalische Barriere gegen hydrophile Substanzen dar, kann aber aufgrund seiner engen und mehrschichtigen Struktur gleichermaßen auch von lipophilen Substanzen nur schwer passiert werden.

[0004] Die vorliegende Erfindung betrifft in einer besonderen Ausführungsform kosmetische oder pharmazeutische Zubereitungen mit vermindertem Klebrigkeitsgefühl, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie die Verwendung von Wirkstoffen zur Herabminderung des Klebrigkeitsgefühles kosmetischer Zubereitungen.

[0005] Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z.B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z.B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

[0006] Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

[0007] Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

[0008] Medizinische Zusammensetzungen enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z.B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

[0009] Häufige Erscheinungsformen kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen sind feindisperse Mehrphasensysteme, in welchen eine oder mehrere Fett- bzw. Ölphasen neben einer bzw. mehreren Wasserphasen vorliegen. Von diesen Systemen sind wiederum die eigentlichen Emulsionen die am weitesten verbreiteten.

[0010] Chitosan stellt ein partiell deacyliertes Chitin dar. Dieses Biopolymer hat u.a. filmbildende Eigenschaften und zeichnet sich durch ein seidiges Hautgefühl aus. Von Nachteil ist jedoch seine starke Klebrigkeit auf der Haut, die insbesondere - vorübergehend - während der Anwendung auftritt. Entsprechende Zubereitungen können dann im Einzelfalle nicht vermarktungsfähig sein, da sie vom Verbraucher nicht akzeptiert bzw. negativ beurteilt werden.

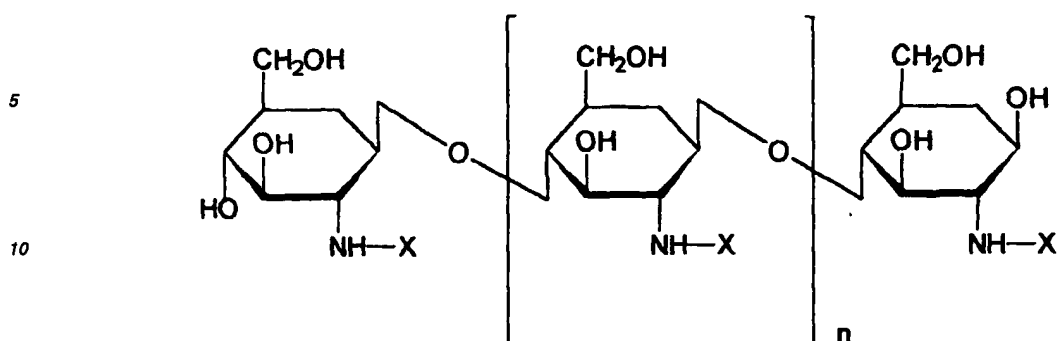
[0011] Es ist zwar bekannt, durch Hinzufügen bestimmter Substanzen, beispielsweise einiger ausgewählter Puderrohstoffe, insbesondere Talkum, dieses Klebrigkeitsgefühl oder auch Schmierigkeitsgefühl zu reduzieren. Davon abgesehen, daß dieses nur selten vollständig gelingt, wird durch einen solchen Zusatz auch die Viskosität des betreffenden Produktes verändert und die Stabilität verringert.

[0012] Aufgabe war daher, all diesen den Nachteilen des Standes der Technik Abhilfe zu schaffen. Insbesondere sollten Produkte mit verringerter Klebrigkeit bzw. Schmierigkeit zur Verfügung gestellt werden. Produkte auf dem Gebiete der pflegenden Kosmetik, der dekorativen Kosmetik und der pharmakologischen Galenik sollten gleichermaßen von den geschilderten Nachteilen des Standes der Technik befreit werden.

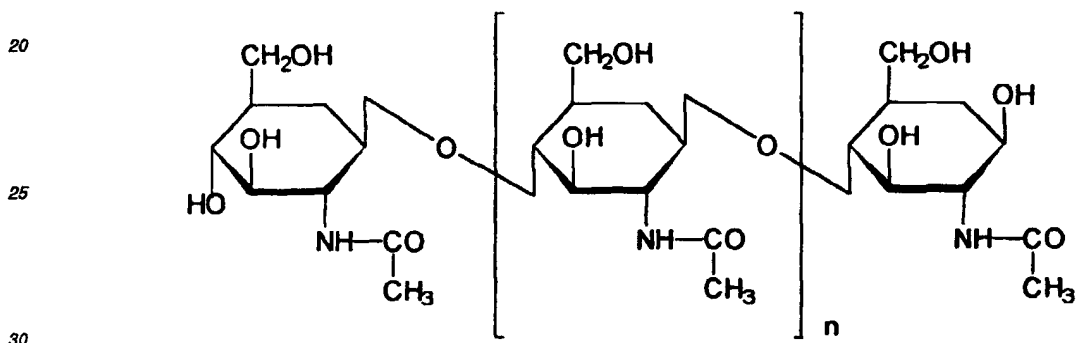
[0013] Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Grundlagen für kosmetische Zubereitungen zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen.

[0014] Ferner war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, Produkte mit einer möglichst breiten Anwendungsvielfalt zur Verfügung zu stellen. Beispielsweise sollten Grundlagen für Zubereitungsformen wie Reinigungsemulsionen, Gesichts- und Körperpflegezubereitungen, aber auch ausgesprochen medizinisch-pharmazeutische Darreichungsformen geschaffen werden, zum Beispiel Zubereitungen gegen Akne und andere Hauterscheinungen.

[0015] Chitosan ist gekennzeichnet durch folgende Strukturformel:



15 dabei nimmt n Werte bis zu ca. 10.000 an, X stellt entweder den Acetylrest oder Wasserstoff dar. Chitosan entsteht durch Deacetylierung und teilweise Depolymerisation (Hydrolyse) von Chitin, welches durch die Strukturformel



gekennzeichnet ist. Chitin ist wesentlicher Bestandteil des Ektoskeletts [$\chi\iota\tau\omega\nu$ = grch.: der Panzerrock] der Gliederfüßer (z.B. Insekten, Krebse, Spinnen) und wird auch in Stützgeweben anderer Organismen (z.B. Weichtiere, Algen, Pilze) gefunden.

[0016] Chitosan ist ein in der Haarpflege bekannter Rohstoff. Es eignet sich, besser als das ihm zugrundeliegende Chitin, als Verdicker oder Stabilisator und verbessert die Adhäsion und Wasserresistenz von polymeren Filmen. Stellvertretend für eine Vielzahl von Fundstellen des Standes der Technik: H.P.Fiedler, „Lexikon der Hilfsstoffe für Pharmazie, Kosmetik und angrenzende Gebiete“, dritte Auflage 1989, Editio Cantor, Aulendorf, S. 293, Stichwort „Chitosan“.

[0017] Im Bereich von etwa $\text{pH} < 6$ ist Chitosan positiv geladen und dort auch in wäßrigen Systemen löslich. Es ist nicht kompatibel mit anionischen Rohstoffen. Daher bietet sich zur Herstellung chitosanhaltiger Öl-in-Wasser-Emulsionen der Einsatz nichtionischer Emulgatoren an. Diese sind an sich bekannt, beispielsweise aus der EP-A 776 657. Die darin aufgeführten Emulsionen (z.B. mit dem O/W-Emulgator Cetylstearylglucosid im Gemisch mit Cetylstearylalkohol) haben jedoch hinsichtlich ihrer sensorischen Qualität gewisse Nachteile.

[0018] Ziel der Erfindung war es daher ferner, chitosanhaltige Zubereitungen, insbesondere Emulsionen, insbesondere O/W-Emulsionen, zur Verfügung zu stellen, die stabil sind, sowohl fließfähig als auch cremartig formulierbar sind, sehr gute kosmetische Eigenschaften besitzen, insbesondere was die Klebrigkeit betrifft, eine sehr gute Hautverträglichkeit sowie Hautpflegeleistung aufweisen.

[0019] Erstaunlicherweise werden diese Aufgaben gelöst durch kosmetische oder dermatologische Zubereitungen, welche

(a) Chitosan eines mittleren Molekulargewichtes von 10.000 bis 2.000.000 g/mol und einem Deacetylierungsgrad von 10 bis 99% und

(b) ein oder mehrere Phospholipide enthalten.

[0020] Die erfindungsgemäßen Zubereitungen zeichnen sich durch erhöhte Stabilität aus, insbesondere wenn sie in Form von Emulsionen, vorteilhaft O/W-Emulsionen, vorliegen. Auch erhöht die Zugabe von Chitosanen und einem oder mehreren Phospholipiden die Stabilität von von Emulsionen, insbesondere O/W-Emulsionen.

[0021] Die erfindungsgemäßen Zubereitungen sind sowohl fließfähig als auch cremartig formulierbar, besitzen sehr gute kosmetische Eigenschaften, insbesondere was die Klebrigkeit betrifft, und weisen eine sehr gute Hautverträglichkeit sowie Hautpflegeleistung auf.

[0022] Erfindungsgemäß bevorzugt sind Chitosane mit einem Deacetylierungsgrad > 25 %, insbesondere > 55 bis 99 % [bestimmt mittels $^1\text{H-NMR}$].

[0023] Es ist von Vorteil, Chitosane mit Molekulargewichten zwischen 10.000 und 2.000.000 zu wählen, insbesondere solches mit Molekulargewichten zwischen 100.000 und 1.000.000. [bestimmt mittels Gelpermetionschromatographie].

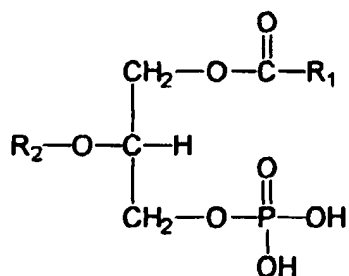
[0024] Erfindungsgemäß enthalten kosmetische oder dermatologische Lichtschutzzubereitungen 0,01 bis 50 Gew.-%, vorteilhaft 0,1 bis 10 Gew.-%, ganz besonders bevorzugt 0,25 bis 2,5 Gew.-% Chitosane.

[0025] Die Einarbeitung des Chitosans erfolgt in der Regel dadurch, daß eine Suspension von Chitosan, insbesondere von micronisiertem Chitosan, in Wasser mit Hilfe von organischen oder anorganischen Säuren auf einen pH-Wert von ca. 3,5 - 5,5 gestellt, wobei - in der Regel durch Rühren - eine Lösung des Chitosans erhalten wird. Die so erhältlichen klaren Lösungen zeichnen sich beispielsweise als 2 Gew.-%ige Lösung von Chitosan in 1,2% Milchsäure (90%ige wäßrige Lösung) durch eine Viskosität nach Viskotester-VT02 (Haake) aus, die im Bereich von 100 bis 10.000 mPas, vorzugsweise von 200 bis 5.000 mPas liegt.

[0026] Vorteilhaft kann beispielsweise Milchsäure verwendet werden, es ist aber ebenfalls von Vorteil, andere Säuren verwendet werden, die lösliche Chitosansalze ergeben, wie z.B. Phosphorsäure, Essigsäure, Ascorbinsäure (diese vorzugsweise unter Verwendung eines Schutzgases), Salzsäure, Glykolsäure, Salpetersäure, 2-Pyrrolidon-5-carbonsäure, Apfelsäure, Salicylsäure, Benzoësäure.

Phospholipide sind Phosphorsäuredi-, oder -monoester, die wegen ihrer fettähnlichen Löslichkeitseigenschaften aufgrund der lipophilen und hydrophilen Komponenten zu den Lipiden gerechnet werden und im Organismus als Membranlipide am Aufbau von Schichten-Strukturen, den Membranen, beteiligt sind.

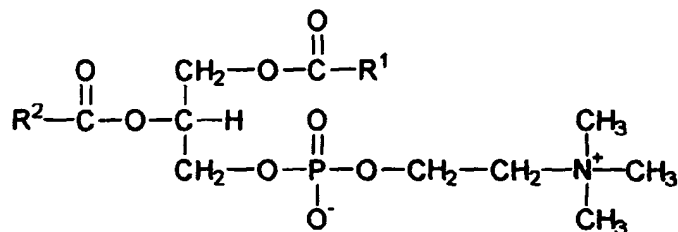
[0027] Phosphatidsäuren sind Glycerinderivate, die in 1-sn- und 2-Stellung mit Fettsäuren (1-sn-Position: meist gesättigt, 2-Position: meist ein- oder mehrfach ungesättigt), an Atom 3-sn dagegen mit Phosphorsäure verestert sind und durch die allgemeine Strukturformel



gekennzeichnet.

[0028] In den in menschlichem oder tierischem Gewebe vorkommenden Phosphatidsäuren ist der Phosphatrest meist verestert mit Aminoalkoholen wie Cholin (Lecithin = 3-sn-Phosphatidylcholin) oder 2-Aminoethanol (Ethanolamin) bzw. L-Serin (Kephalin = 3-sn-Phosphatidylethanolamin bzw. sn-Phosphatidyl-L-serin), mit myo-Inosit zu den in Geweben häufigen Phosphoinositiden [1-(3-sn-Phosphatidyl)-D-myo-inositen], mit Glycerin zu Phosphatidylglycerinen.

[0029] Lecithine sind durch die allgemeine Strukturformel



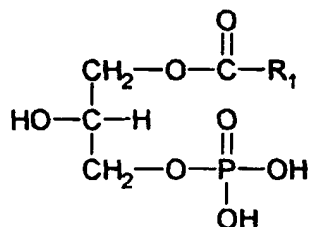
gekennzeichnet, wobei R und R² typischerweise unverzweigte aliphatische Reste mit 15 oder 17 Kohlenstoffatomen und bis zu 4 cis-Doppelbindungen darstellen.

[0030] Cardiolipine (1,3-Bisphosphatidylglycerine) sind Phospholipide aus zwei über Glycerin verknüpften Phospha-

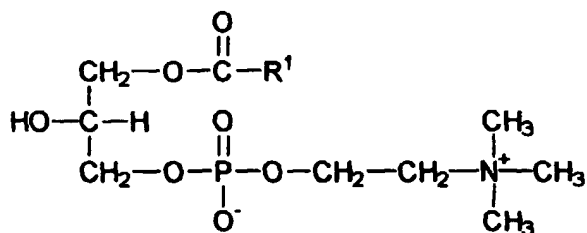
tidsäuren.

Lysophospholipide werden erhalten, wenn aus Phospholipiden ein Acylrest durch Phospholipase A abgespalten wird (z.B. Lysolecithine).

[0031] Lysophospholipide sind gekennzeichnet durch die allgemeine Strukturformel



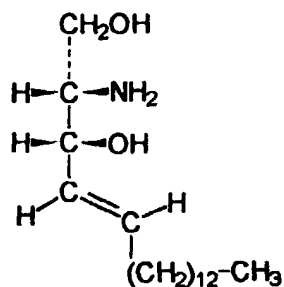
[0032] Lysolecithine beispielsweise sind gekennzeichnet durch die allgemeine Strukturformel



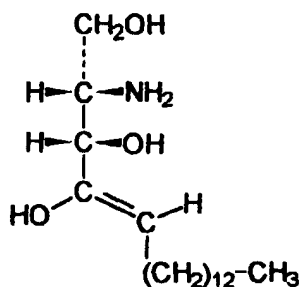
wobei R und R² typischerweise unverzweigte aliphatische Reste mit 15 oder 17 Kohlenstoffatomen und bis zu 4 cis-Doppelbindungen darstellen.

[0033] Zu den Phospholipide werden auch Plasmalogene gezählt, in denen statt einer Fettsäure in 1-Stellung ein Aldehyd (in Form eines Enolethers) gebunden ist; die den Phosphatidylcholinen entsprechenden O-1-sn-Alkenyl-Verb. z. B. heißen Phosphatidalcholine.

[0034] Den Phosphosphingolipiden liegt als Grundstruktur das Sphingosin oder auch das Phytosphingosin zugrunde, welche sich durch folgende Strukturformeln auszeichnen:

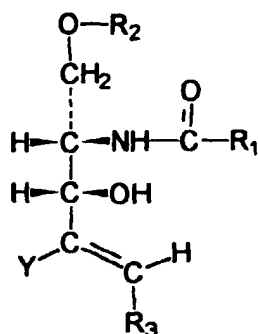


(Sphingosin)



(Phytosphingosin)

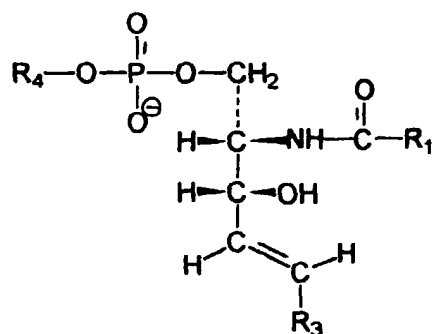
[0035] Abwandlungen von Sphingolipiden zeichnen sich beispielsweise aus durch die allgemeine Grundstruktur



bei welcher R_1 und R_3 unabhängig voneinander gesättigte oder ungesättigte, verzweigte oder unverzweigte Alkylreste von 1 bis 28 Kohlenstoffatomen darstellen, R_2 gewählt wird aus der Gruppe: Wasserstoffatom, gesättigte oder ungesättigte, verzweigte oder unverzweigte Alkylreste von 1 bis 28 Kohlenstoffatomen, Zuckerreste, mit organischen Resten veresterte oder unveresterte Phosphatgruppen, mit organischen Resten veresterte oder unveresterte Sulfatgruppen und Y entweder ein Wasserstoffatom, eine Hydroxygruppe oder einen anderen hetero-funktionellen Rest darstellt.

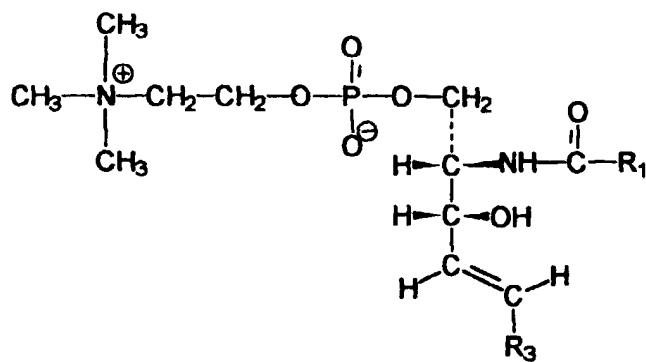
Sphingophospholipide:

[0036]



[0037] R_1 und R_3 stellen Alkylreste dar, R_4 stellt einen Organylrest dar.

[0038] Sphingomyeline sind organylphosphorylierte Sphingolipide des Typs



[0039] Bevorzugte Phospholipide sind Lecithine. Vorteilhaft zu verwendende Lecithintypen werden gewählt aus Rohlecithinen, welche entölt und/oder fraktioniert und/oder sprühgetrocknet und/oder acetyliert und/oder hydrolysiert und/oder hydriert wurden.

5 [0040] Erfindungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Phospholipide sind beispielsweise käuflich zu erwerben unter den Handelsbezeichnungen Phospholipon 25 (Nattermann), Emulmetik 120 (Lucas Meyer), Stempur E (Stern), Stempur PM (Stern), Nathin 3KE (Stern).

[0041] Die Menge der Phospholipide (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 0,5 - 5% Gew.-%, bezogen auf das

10 Gesamtgewicht der Zubereitung.

[0042] Erfindungsgemäß ist es möglich und vorteilhaft, den Anteil der Ölphase der erfindungsgemäßen Zubereitungen im Bereich von 0,01 bis 99 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, frei zu wählen.

[0043] Als Grundbestandteile der erfindungsgemäßen Zubereitungen können verwendet werden:

- 15 - Wasser oder wäßrige Lösungen
- wäßrige ethanolische Lösungen
- natürliche Öle und/oder chemisch modifizierte natürliche Öle und/oder synthetische Öle;
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkan-
- 20 säuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkohole, Diöle oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

25 [0044] Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet.

[0045] Die Ölphase der Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten

30 und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylrucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher

35 Ester, z.B. Jojobaöl.

[0046] Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der

40 Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z.B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

[0047] Erfindungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Fett- und/oder Wachskomponenten können aus der Gruppe der pflanzlichen Wachse, tierischen Wachse, Mineralwachse und petrochemischen Wachse gewählt werden. Erfindungsgemäß günstig sind beispielsweise Candelillawachs, Camaubawachs, Japanwachs, Espartograswachs, Korkwachs, Guarumawachs, Reiskeimölwachs, Zuckerrohrwachs, Beerewachs, Ouricurywachs, Montanwachs, Jojobawachs, Shea Butter, Bienenwachs, Schellackwachs, Walrat, Lanolin (Wollwachs), Bürzelfett, Ceresin, Ozokerit (Erdwachs), Paraffinwachs und Mikrowachs.

[0048] Weitere vorteilhafte Fett- und/oder Wachskomponenten sind chemisch modifizierte Wachse und synthetische

50 Wachse, wie beispielsweise die unter den Handelsbezeichnungen Syncrowax HRC (Glyceritribehenat), Syncrowax HGLC (C₁₆₋₃₆-Fettsäuretriglycerid) und Syncrowax AW 1C (C₁₈₋₃₆-Fettsäure) bei der CRODA GmbH erhältlichen sowie Montanesterwachs, Sasolwachs, hydrierte Jojobawachs, synthetische oder modifizierte Bienenwachs (z. B. Dimeithicon Copolyol Bienenwachs und/oder C₃₀₋₅₀-Alkyl Bienenwachs), Polyalkylenwachse, Polyethylenglykolwachs, aber auch chemisch modifizierte Fette, wie z. B. hydrierte Pflanzenöle (beispielsweise hydriertes Ricinusöl und/oder hydrierte Cocosfettglyceride), Triglyceride, wie beispielsweise Trihydroxystearin, Fettsäuren, Fettsäureester und Glyko-

55 lester, wie beispielsweise C₂₀₋₄₀-Alkylstearat, C₂₀₋₄₀-Alkylhydroxystearoylstearat und/oder Glykolmontanat. Weiter vorteilhaft sind auch bestimmte Organosiliciumverbindungen, die ähnliche physikalische Eigenschaften aufweisen wie die genannten Fett- und/oder Wachskomponenten, wie beispielsweise Stearoxtrimethylsilan.

[0049] Erfindungsgemäß können die Fett- und/oder Wachskomponenten sowohl einzeln als auch im Gemisch vorliegen.

[0050] Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

[0051] Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Iseicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

[0052] Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkybenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkybenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkybenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

[0053] Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Cycloparaffin, Squalan, Squalen, hydriertes Polyisobuten bzw. Polydecen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

[0054] Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

[0055] Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

[0056] Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

[0057] Erfindungsgemäße Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung, z.B. in Form einer Hautschutzcreme, einer Hautlotion, einer kosmetischen Milch, beispielsweise in Form einer Sonnenschutzcreme oder einer Sonnenschutzmilch, sind vorteilhaft und enthalten z.B. Fette, Öle, Wachse und/oder andere Fettkörper, sowie Wasser und einen oder mehrere Emulgatoren, wie sie üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet werden.

[0058] Es ist dem Fachmanne natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zusammensetzungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfüm, Farbstoffe, Emulgatoren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insektenrepellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw.

[0059] Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen.

[0060] Medizinische topische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z.B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

[0061] Entsprechend können kosmetische oder topische dermatologische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcreme, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährcreme, Tages- oder Nachtcreme usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden.

[0062] Es ist ebenfalls von Vorteil, von den erfindungsgemäßen Eigenschaften in Form von dekorativen Kosmetika (Make-Up-Formulierungen) Gebrauch zu machen.

[0063] Günstig sind auch solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorzugsweise enthalten diese neben dem erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff zusätzlich mindestens eine UVA-Filtersubstanz und/oder mindestens eine UVB-Filtersubstanz und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

[0064] Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden beispielsweise in Tagescrèmes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet.

[0065] Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

[0066] Die UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z.B. zu nennen:

- 3-Benzylidencampher und dessen Derivate, z.B. 3-(4-Methylbenzyliden)campher,
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicyl-

säurehomomenthylester;

- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- 5 - 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin

[0067] Als wasserlösliche Substanzen sind vorteilhaft:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Salze, z.B. Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze,
- 10 - Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze.

15 [0068] Die Liste der genannten UVB-Filter, die erfindungsgemäß Verwendung finden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

[0069] Es kann auch von Vorteil sein, in erfindungsgemäßen Zubereitungen UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen enthalten sind. Bei solchen Filtersubstanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die gleichen Mengen an UVA-Filtersubstanzen verwendet werden, welche für UVB-Filtersubstanzen genannt wurden.

[0070] Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

[0071] Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Wirk-, Hilfs- und/oder Zusatzstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z.B. Antioxidationsmittel, Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

[0072] Es ist vorteilhaft, den Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung weitere antiirritative oder antientzündliche Wirkstoffe zuzugeben, insbesondere Batylalkohol (α -Octadecylglycerylether), Selachylalkohol (α -9-Octadecenylglycerylether), Chimylalkohol (α -Hexadecylglycerylether), Bisabolol und/oder Panthenol.

[0073] Es ist ebenfalls vorteilhaft, den Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung übliche Antioxidantien zuzufügen. Erfindungsgemäß können als günstige Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.

[0074] Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B. α -Carotin, β -Carotin, ψ -Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis μ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxysäuren (z.B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B. γ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Furfurylidensorbitol und dessen Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, α -Glycosylrutin, Ferulasäure, Furfurylidenglucitol, Camosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure,

Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivat, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO₄) Seien und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

5 [0075] Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindung n) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

[0076] Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

10 [0077] Zubereitungen gemäß der vorliegenden Erfindung können auch Verwendung als Grundlage für kosmetische oder dermatologische Desodorantien bzw. Antitranspirantien finden. Alle für Desodorantien bzw. Antitranspirantien gängigen Wirkstoffe können vorteilhaft genutzt werden, beispielsweise Geruchsüberdecker wie die gängigen Parfümbestandteile, Geruchsabsorber, beispielsweise die in der Patentreffenlegungsschrift DE-P 40 09 347 beschriebenen Schichtsilikate, von diesen insbesondere Montmorillonit, Kaolinit, Illit, Beidellit, Nontronit, Saponit, Hectorit, Bentonit, Smectit, ferner beispielsweise Zinksalze der Ricinolsäure.

[0078] Keimhemmende Mittel sind ebenfalls geeignet, in die erfindungsgemäßen Zubereitungen eingearbeitet zu werden. Vorteilhafte Substanzen sind zum Beispiel 2,4,4'-Trichlor-2'-hydroxydiphenylether (Irgasan), 1,6-Di-(4-chlorphenylbiguanido)-hexan (Chlorhexidin), 3,4,4'-Trichlorcarbanilid, quaternäre Ammoniumverbindungen, Nelkenöl, Minzöl, Thymianöl, Triethylcitrat, Farnesol (3,7,11-Trimethyl-2,6,10-dodecatrien-1-ol) sowie die in den Patentreffenlegungsschriften DE-37 40 186, DE-39 38 140, DE-42 04 321, DE-42 29 707, DE-43 09 372, DE-44 11 664, DE-195 41 967, DE-195 43 695, DE-195 43 696, DE-195 47 160, DE-196 02 108, DE-196 02 110, DE-196 02 111, DE-196 31 003, DE-196 31 004 und DE-196 34 019 und den Patentschriften DE-42 29 737, DE-42 37 081, DE-43 24 219, DE-44 29 467, DE-44 23 410 und DE-195 16 705 beschriebenen Wirkstoffe bzw. Wirkstoffkombinationen. Auch Natriumhydrogencarbonat ist vorteilhaft zu verwenden.

25 [0079] Die Menge solcher Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen gemäß der Erfindung beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

[0080] Als Treibmittel für aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

30 [0081] Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die Verwirklichung der vorliegenden Erfindung in Form von Aerosolpräparaten geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe und Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

[0082] Kosmetische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung zur Behandlung und Pflege der Haare, die den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff enthalten, können als Emulsionen vorliegen, die vom nicht-ionischen oder anionischen Typ sind. Nicht-ionische Emulsionen enthalten neben Wasser Öle oder Fettalkohole, die beispielsweise auch polyethoxyliert oder polypropoxyliert sein können, oder auch Gemische aus den beiden organischen Komponenten. Diese Emulsionen enthalten gegebenenfalls kationische oberflächenaktive Substanzen.

40 [0083] Die Wasserphase der kosmetischen Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung kann auch Gelcharakter aufweisen, die neben einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß eingesetzten Substanzen und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln, bevorzugt Wasser, noch weitere organische Verdickungsmittel, z.B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Stärke und Stärkederivate (z.B. Distärkephosphat), Cellulose, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise organisch modifizierte oder auch unmodifizierte Hectorite, Bentonite, oder dergleichen, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolestearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist in dem Gel z.B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

50 [0084] Ferner kann es von Vorteil sein, Zubereitungen gemäß der Erfindung grenz- bzw. oberflächenaktive Agentien zuzufügen, beispielsweise kationische Emulgatoren wie insbesondere quaternäre Tenside.

[0085] Quaternäre Tenside enthalten mindestens ein N-Atom, das mit 4 Alkyl- oder Arylgruppen kovalent verbunden ist. Dies führt, unabhängig vom pH Wert, zu einer positiven Ladung. Vorteilhaft sind, Alkylbetain, Alkylamidopropylbetain und Alkyl-amidopropylhydroxysulfain. Die erfindungsgemäß verwendeten kationischen Tenside können ferner bevorzugt gewählt werden aus der Gruppe der quaternären Ammoniumverbindungen, insbesondere Benzyltrialkylammoniumchloride oder -bromide, wie beispielsweise Benzyltrimethylstearylammmoniumchlorid, ferner Alkyltrialkylammoniumsalze, beispielsweise beispielsweise Cetyltrimethylammoniumchlorid oder -bromid,

Alkyldimethylhydroxyethylammoniumchloride oder -bromide, Dialkyldimethylammoniumchloride oder -bromide, Alkylamidethyltrimethylammoniumethersulfate, Alkylpyridiniumsalze, beispielsweise Lauryl- oder Cetylpyrimidiniumchlorid, Imidazolinderivate und Verbindungen mit kationischem Charakter wie Aminoxide, beispielsweise Alkyldimethylaminoxide oder Alkylaminoethyltrimethylaminoxide. Vorteilhaft sind insbesondere Cetyltrimethylammoniumsalze zu verwenden.

[0086] Vorteilhaft ist auch, kationische Polymere (z.B. Jaguar C 162 [Hydroxypropyl Guar Hydroxypropyltrimonium Chloride] bzw. modifizierten Magnesiumaluminiumsilikaten (z.B. Quaternium-18-Hectorit, welches z. B. unter der Handelsbezeichnung Bentone® 38 bei der Firma Rheox erhältlich ist, oder Stearalkonium Hectorit, welches z. B. unter der Handelsbezeichnung Softisan® Gel bei der Hüls AG erhältlich ist), einzusetzen.

[0087] Erfindungsgemäße Zubereitungen können vorteilhaft auch Ölverdickungsmittel enthalten, um die taktilen Eigenschaften der Emulsion und die Stiftkonsistenz zu verbessern. Vorteilhafte Ölverdickungsmittel im Sinne der vorliegenden Erfindung sind beispielsweise weitere Feststoffe, wie z. B. hydrophobe Siliciumoxide des Typs Aerosil®, welche von der Degussa AG erhältlich sind. Vorteilhafte Aerosil®-Typen sind beispielsweise Aerosil® OX50, Aerosil® 130, Aerosil® 150, Aerosil® 200, Aerosil® 300, Aerosil® 380, Aerosil® MOX 80, Aerosil® MOX 170, Aerosil® COK 84, Aerosil® R 202, Aerosil® R 805, Aerosil® R 812, Aerosil® R 972, Aerosil® R 974 und/oder Aerosil® R976.

[0088] Ferner sind auch sogenannte Metallseifen (d. h. die Salze höherer Fettsäuren mit Ausnahme der Alkalisalze) vorteilhafte Ölverdickungsmittel im Sinne der vorliegenden Erfindung, wie beispielsweise Aluminium-Stearat, Zink-Stearat und/oder Magnesium-Stearat.

[0089] Ebenfalls vorteilhaft ist, Zubereitungen gemäß der Erfindung amphotere bzw. zwitterionischen Tensiden (z.B. Cocoamidopropylbetain) und Moisturizern (z.B. Betain) zuzusetzen. Vorteilhaft zu verwendende amphotere Tenside sind beispielsweise Acyl-/dialkylethylendiamin, beispielsweise Natriumacylamphoacetat, Dinatriumacylamphodipropionat, Dinatriumalkylamphodiaceat, Natriumacylamphohydroxypropylsulfonat, Dinatriumacylamphodiaceat und Natriumacylamphopropionat, N-Alkylaminosäuren, beispielsweise Aminopropylalkylglutamid, Alkylaminopropionsäure, Natriumalkylimidodipropionat und Lauroamphocarboxyglycinat.

[0090] Die Menge der ober- bzw. grenzflächenaktiven Substanzen (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen gemäß der Erfindung beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

[0091] Erfindungsgemäße Zubereitungen können auch Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) enthalten, welche gewählt werden aus der Gruppe: Acetylsalicylsäure, Atropin, Azulen, Hydrocortison und dessen Derivaten, z.B. Hydrocortison-17-valerat, Vitamine, z.B. Ascorbinsäure und deren Derivate, Vitamine der B- und D-Reihe, sehr günstig das Vitamin B₁, das Vitamin B₁₂ das Vitamin D₁, aber auch Bisabolol, ungesättigte Fettsäuren, namentlich die essentiellen Fettsäuren (oft auch Vitamin F genannt), insbesondere die γ -Linolensäure, Ölsäure, Eicosapentaensäure, Docosahexaensäure und deren Derivate, Chloramphenicol, Coffein, Prostaglandine, Thymol, Campher, Extrakte oder andere Produkte pflanzlicher und tierischer Herkunft, z.B. Nachtkerzenöl, Borretschöl oder Johannisbeerkernöl, Fischöle, Lebertran aber auch Ceramide und ceramidähnliche Verbindungen und so weiter. Vorteilhaft ist es auch, die Wirkstoffe aus der Gruppe der rückfettenden Substanzen zu wählen, beispielsweise Purcellinöl, Eucerit® und Neocerit®.

[0092] Die Menge solcher Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen gemäß der Erfindung beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

[0093] Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen.

Herstellungsbeispiel Chitosanlösung:

[0094]

	Gew.-%
Chitosan	2,0
Milchsäure (90%ige wäßrige Lösung)	1,2
Wasser	ad 100,00
pH-Wert ca.	4,5

EP 0 965 330 A1

Beispiel 1 (O/W-Emulsion):

[0095]

5

10

15

	Gew.-%
Sonnenblumenkernöl	5,00
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Lecithin	1,00
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

20 Beispiel 2 (O/W-Emulsion):

[0096]

25

30

35

	Gew.-%
Weizenkeimöl	5,0
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,0
Lecithin	1,0
Distärkephosphat	1,0
Glycerin	3,0
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
pH-Wert	ca. 4,5
Wasser	ad. 100,0

40

Beispiel 3 (O/W-Emulsion):

[0097]

45

50

55

	Gew.-%
Jojobaöl	3,00
Caprylic/Capric Triglyceride	3,00
Dimethicon	0,50
Dimethiconol	0,10
Cyclomethicon	2,00
Dimeticoncopolyol	0,20
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00

EP 0 965 330 A1

(fortgesetzt)

	Gew.-%
Lecithin	2,00
Tocopherolacetat	0,50
Panthenol	0,50
Biotin	0,10
Glycerin	3,00
1,3 Butylenglycol	1,50
Serine	0,20
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 4 (O/W-Emulsion):

[0098]

	Gew.-%
Dimethicon	2,00
Cyclomethicon	2,00
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Lecithin	1,50
Distarch Phosphate	1,00
Glycerin	3,00
Betain	2,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 5 (O/W-Emulsion):

[0099]

	Gew.-%
Sonnenblumenkernöl	12,00
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	75,00
Lecithin	4,00
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00

EP 0 965 330 A1

(fortgesetzt)

	Gew.-%
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 6 (O/W-Emulsion):

[0100]

	Gew.-%
Saffloröl	5,00
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Lecithin	1,00
Glycerin	5,00
Distärkephosphat	1,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 7 (O/W-Emulsion):

[0101]

	Gew.-%
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Octyldodecanol	2,00
Squalan	2,00
Paraffinum liquidum	1,00
Hydriertes Polysorbaten	1,00
Lecithin	2,00
4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan	2,00
Octylmethoxycinnamat	2,50
4-Methyl-Benzylidencampher	2,50
Tris-[anilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)]-triazin	1,50
Titandioxid	2,00
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

EP 0 965 330 A1

Beispiel 8 (O/W-Emulsion):

[0102]

5

10

15

20

	Gew.-%
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Octyldodecanol	1,00
C ₁₂₋₁₅ -Alkyl Benzoate	1,00
Squalan	1,00
Lecithin	1,50
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 9 (O/W-Emulsion):

25 [0103]

30

35

40

45

50

55

	Gew.-%
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Octyldodecanol	1,00
Dicaprylylether	1,00
Squalan	1,00
Paraffinum liquidum	1,00
Hydriertes Polysobuten	1,00
Glycerylstearatcitrat	0,40
Cetylstearylalkohol	0,20
Lecithin	1,50
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 10 (O/W-Emulsion):

[0104]

5

10

15

20

	Gew.-%
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Distearyldimethylammoniumchlorid	2,00
Squalan	2,00
Paraffinum liquidum	2,00
Hydriertes Polysiobuten	2,00
Lecithin	1,50
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 11 (W/O-Emulsion):

25

[0105]

30

35

40

45

50

55

	Gew.-%
PEG-7-hydriertes Ricinusöl	4,00
Wollwachsalkohol	1,50
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	0,20
Squalan	1,00
Lecithin	0,20
Bienenwachs	3,00
Vaseline	4,00
Ozokerit	4,00
Paraffinöl, subliquidum	8,00
4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan	2,00
Octylmethoxycinnamat	2,50
4-Methyl-Benzylidencampher	2,50
Tris-[anilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)]-triazin	1,50
Titandioxid	2,00
Tocopherolacetat	1,00
Glycerin	3,00
Natriumchlorid	0,70
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00

Beispiel 12 (W/O-Emulsion):

[0106]

5

10

15

20

Polyglyceryl-3 Dioleat	Gew.-% 3,50
Ozokerit	3,00
Bienenwachs	2,00
Paraffinöl, subliquidum	10,00
Cetylstearyl-octanoat	10,00
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	20,00
Lecithin	0,40
Glycerin	5,00
Natriumchlorid	0,70
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00

Beispiel 13 (W/O-Emulsion)

25

[0107]

30

35

40

45

	Gew.-%
Laurylmethiconcopolyol	1,50
Cetylmethiconcopolyol	0,50
Paraffinöl, subliquidum	20,00
Cylomethicon	2,00
Dimethicon	5,00
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	10,00
Lecithin	0,20
Glycerin	10,00
Natriumchlorid	1,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00

50

55

EP 0 965 330 A1

Beispiel 14 („Hydrodispersion“):

[0108]

5

10

15

20

	Gew.-%
Sonnenblumenkernöl	2,50
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Lecithin	0,10
Distärkephosphat	1,00
Hectorit	0,50
Celluloseglycolat	0,50
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 15 („Hydrodispersion“):

25

[0109]

30

35

40

45

	Gew.-%
Sonnenblumenkernöl	2,50
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Lecithin	0,10
Distärkephosphat	1,00
Tromethaminmagnesiumaluminiumsilicat	0,50
Celluloseglycolat	0,50
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 16 (Emulsions-Make-up)

[0110]

50

55

	Gew.-%
Sonnenblumenkernöl	7,50
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Lecithin	2,00

EP 0 965 330 A1

(fortgesetzt)

	Gew.-%
Distärkephosphat	1,00
Dimethicon	0,50
Glycerin	1,50
Magnesiumsilikat	1,00
Glimmer	1,00
Eisenoxide	1,00
Titandioxid	2,50
Talkum	5,00
Tapiocastärke	0,25
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 17 (Emulsions-Lippenpflegestift)

[0111]

	Gew.-%
Octyldodecanol	20,00
Polyglyceryl-3-dioleat	3,50
Bienenwachs	12,50
Squalan	11,00
C ₂₀₋₄₀ -Alkylstearate	5,00
Jojobaöl	10,00
Carnaubawachs	2,00
Tocopherolacetat	0,70
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	5,00
Lecithin	1,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Caprylsäure/Caprinsäuretriglyceride	ad 100,0

Beispiel 18 (Alkoholisches Gesichtswasser)

[0112]

	Gew.-%
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Lecithin	0,10

EP 0 965 330 A1

(fortgesetzt)

	Gew.-%
Ethanol	ad 100,00

Beispiel 19 (O/W-Emulsion)

[0113]

	Gew.-%
Sojaöl	5,00
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Lecithin	1,00
Hydroxypropylmethylcellulose	0,50
Ethanol	5,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

Beispiel 20 (O/W-Emulsion)

[0114]

	Gew.-%
Sojaöl	5,00
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00
Lecithin	1,00
Isostearylphosphat	0,25
Ammoniumphosphatid	0,25
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.
Wasser	ad. 100,00
pH-Wert	ca. 4,5

[0115] Ein Vergleich der Formulierungen mit der erfindungsgemäß verwendeten Kombinationen aus Chitosan und Phospholipiden (hier verwendet: Lecithin) mit Formulierungen, welche nur einen der Bestandteile Chitosan und Phospholipide enthält, zeigt, daß die erfindungsgemäß verwendeten Kombinationen zu erhöhter Stabilität der zugrundeliegenden Emulsionen (hier O/W-Emulsionen) führen.

O/W-Emulsion analog Beispiel 1

[0116]

	Gew.-%		
Sonnenblumenkernöl	5,00	5,00	5,00
Chitosanlösung gem. Herstellungsbeispiel	50,00	-	50,00
Lecithin	1,00	1,00	-
Glycerin	3,00	3,00	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, Antioxidantien	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100,00	ad 100,00	ad 100,00
pH-Wert	4,5	4,5	4,5
Stabilität der Emulsion:	stabil	instabil	instabil

Patentansprüche**1. Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen, welche**

- (a) Chitosan eines mittleren Molekulargewichtes von 10.000 bis 2.000.000 g/mol und einem Deacylierungsgrad von 10 bis 99% und
 (b) ein oder mehrere Phospholipide enthalten.

2. Verwendung von Kombinationen aus

- (a) Chitosan eines mittleren Molekulargewichtes von 10.000 bis 2.000.000 g/mol und einem Deacylierungsgrad von 10 bis 99% und
 (b) ein oder mehrere Phospholipide zur Herstellung nicht-klebriger kosmetischer Zubereitungen, insbesondere O/W-Emulsionen oder zur Verminderung der Klebrigkeit von kosmetischer Zubereitungen, insbesondere O/W-Emulsionen.

3. Verwendung von Kombinationen aus

- (a) Chitosan eines mittleren Molekulargewichtes von 10.000 bis 2.000.000 g/mol und einem Deacylierungsgrad von 10 bis 99% und
 (b) ein oder mehrere Phospholipide zur Erhöhung der Stabilität kosmetischer Zubereitungen, insbesondere O/W-Emulsionen.



Europäisch
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung
EP 99 11 0757

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.Cl.6)
X	EP 0 771 566 A (UNIV SANTIAGO COMPOSTELA) 7. Mai 1997 (1997-05-07) * Zusammenfassung; Ansprüche 1-13; Beispiel 3 *	1-3	A61K7/48 A61K9/107 A61K47/24 A61K47/36
X	US 5 518 736 A (BACH URI ET AL) 21. Mai 1996 (1996-05-21) * Ansprüche 1-13 *	1-3	
X	FR 2 667 072 A (BIOETICA SA) 27. März 1992 (1992-03-27) * Seite 2, Zeile 12 - Zeile 20 * * Seite 5, Zeile 11 - Zeile 18 * * Ansprüche 1-14 *	1-3	
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 098, no. 001, 30. Januar 1998 (1998-01-30) & JP 09 241152 A (SUNSTAR INC), 16. September 1997 (1997-09-16) * Zusammenfassung *	1-3	
			RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int.Cl.6)
			A61K
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt			
Recherchenort		Abschlußdatum der Recherche	
DEN HAAG		15. September 1999	
		Prüfer	
		Stienon, P	
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE			
X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : mündliche Offenbarung P : Zwischenliteratur		T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze E : älteres Patentedokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus anderen Gründen angeführtes Dokument & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument	

EPO FORM 1503 03.82 (P04033)

**ANHANG ZUM EUROPÄISCHEN RECHERCHENBERICHT
 ÜBER DIE EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG NR.**

EP 99 11 0757

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten europäischen Recherchenbericht angeführten Patentedokumente angegeben.

Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am
 Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

15-09-1999

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0771566 A	07-05-1997	ES 2093562 A	16-12-1996
		US 5843509 A	01-12-1998
		CA 2195881 A	28-11-1996
		WO 9637232 A	28-11-1996
US 5518736 A	21-05-1996	AU 2573795 A	19-01-1996
		EP 0772434 A	14-05-1997
		WO 9600056 A	04-01-1996
		US 5753264 A	19-05-1998
FR 2667072 A	27-03-1992	KEINE	
JP 09241152 A	16-09-1997	KEINE	

EPO FORM P0461

Für nähere Einzelheiten zu diesem Anhang : siehe Amtsblatt des Europäischen Patentamts, Nr.12/82